

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/087517 A2**

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A61K 7/00** Hamburg (DE). **STÄB, Franz** [DE/DE]; Bäckerstrasse 3, 21279 Echem (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP02/04625**
- (22) Internationales Anmeldedatum:  
26. April 2002 (26.04.2002)
- (25) Einreichungssprache: **Deutsch**
- (26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**
- (30) Angaben zur Priorität:  
101 21 375.1 2. Mai 2001 (02.05.2001) **DE**
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BEIERSDORF AG** [DE/DE]; Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder. (nur für US): **BIERGIESSER, Helga** [DE/DE]; Sandweg 16, 21465 Reinbek (DE). **DÖRING, Thomas** [DE/DE]; Quadenweg 3, 22453 Hamburg (DE). **GALLINAT, Stefan** [DE/DE]; Martin-Niemöller-Strasse 13, 22880 Wedel (DE). **KOLBE, Ludger** [DE/DE]; Wiesenstrasse 16, 21255 Dohren (DE). **VENZKE, Kirsten** [DE/DE]; Novalisweg 27, 22303
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **BEIERSDORF AG**; Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): **JP, US**.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).
- Erklärungen gemäß Regel 4.17:**
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten JP, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR)
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Veröffentlicht:**
- ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: **USE OF ISOFLAVONOIDS IN COSMETIC OR DERMATOLOGICAL PREPARATIONS FOR THE PROPHYLAXIS OR TREATMENT OF SENSITIVE SKIN**

(54) Bezeichnung: **VERWENDUNG VON ISOFLAVONOIDEN IN KOSMETISCHEN ODER DERMATOLOGISCHEN ZUBEREITUNGEN ZUR PROPHYLAXE VOR UND BEHANDLUNG VON SENSIBLER HAUT**

(57) Abstract: The invention relates to the use of derivatives of the isoflavones selected from the group: genistein, genistin, daidzein, daidzin, biochanin A, glycitein, glycitin, santal, orobol, pratensein, prunetin and/or equol, in cosmetic or dermatological preparations for the treatment and prophylaxis of the symptoms of inflammatory and/or itching skin conditions in sensitive skin and in changes to the DNS synthesis and/or DNS repair in the skin.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von Derivaten des Isoflavons gewählt aus der Gruppe: Genistein, Genistin, Daidzein, Daidzin, Biochanin A, Glycitein, Glycitin, Santal, Orobol, Pratensein, Prunetin und/oder Equol, in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome von entzündlichen und/oder juckenden Hautzuständen, bei sensibler Haut sowie bei Veränderungen der DNS-Synthese und/oder DNS-Reparatur in der Haut.

WO 02/087517 A2

5

## Beschreibung

**Verwendung von Isoflavonoiden in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe vor und Behandlung von sensibler Haut**

10

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung spezieller Isoflavonoide in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe vor und Behandlung von sensibler Haut, Juckreiz, sowie von Veränderungen der DNS-Synthese- und/oder DNS-Reparaturleistung in der Haut.

15

Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische Zubereitungen mit einem zusätzlichen, wirksamen Schutz vor schädlichen Oxidationsprozessen in der Haut, aber auch zum zusätzlichen Schutz kosmetischer Zubereitungen selbst bzw. zum zusätzlichen Schutz der Bestandteile kosmetischer Zubereitungen vor schädlichen Oxidations-

20

prozessen.

25

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

30

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Um-

welteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Die chronologische Hautalterung wird z. B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z. B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff „Senile Xerosis“ fallen können:

- a) Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,
- 10 b) Juckreiz und
- c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z. B. nach Waschen).

Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein. In Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z. B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut:

- d) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit).

Produkte zur Pflege sensibler, juckender und/oder trockener Haut bzw. Produkte zur Behandlung von oder Prophylaxe vor DNS-Schädigungen sind an sich bekannt. Allerdings ist deren Wirksamkeit begrenzt.

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. Während Strahlen mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist (der sogenannte UVC-Bereich), von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert werden, verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UVB-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

Zum Schutz gegen UVB-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es

sich um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoesäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

5 Auch für den Bereich zwischen etwa 320 nm und etwa 400 nm, des sogenannten UVA-Bereich, ist es wichtig, Filtersubstanzen zur Verfügung zu haben, da dessen Strahlen Reaktionen bei lichtempfindlicher Haut hervorrufen können. Es ist erwiesen, daß UVA-Strahlung zu einer Schädigung der elastischen und kollagenen Fasern des Bindegewebes führt, was die Haut vorzeitig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher photo-  
10 toxischer und photoallergischer Reaktionen zu sehen ist. Der schädigende Einfluß der UVB-Strahlung kann durch UVA-Strahlung verstärkt werden.

Zum Schutz gegen die Strahlen des UVA-Bereichs werden daher gewisse Derivate des Dibenzoylmethans verwendet, deren Photostabilität (Int. J. Cosm. Science 10, 53 (1988)),  
15 nicht in ausreichendem Maße gegeben ist.

Die UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen.

20 Vorwiegend handelt es sich bei solchen photochemischen Reaktionsprodukten um radikalische Verbindungen, beispielsweise Hydroxyradikale. Auch undefinierte radikalische Photoprodukte, welche in der Haut selbst entstehen, können aufgrund ihrer hohen Reaktivität unkontrollierte Folgereaktionen an den Tag legen. Aber auch Singulett-sauerstoff, ein nichtradikalischer angeregter Zustand des Sauerstoffmoleküls kann bei UV-  
25 Bestrahlung auftreten, ebenso kurzlebige Epoxide und viele andere. Singulett-sauerstoff beispielsweise zeichnet sich gegenüber dem normalerweise vorliegenden Triplett-sauerstoff (radikalischer Grundzustand) durch gesteigerte Reaktivität aus. Allerdings existieren auch angeregte, reaktive (radikalische) Triplettzustände des Sauerstoffmoleküls.

30 Ferner zählt UV-Strahlung zur ionisierenden Strahlung. Es besteht also das Risiko, daß auch ionische Spezies bei UV-Exposition entstehen, welche dann ihrerseits oxidativ in die biochemischen Prozesse einzugreifen vermögen.

Um diesen Reaktionen vorzubeugen, können den kosmetischen bzw. dermatologischen

Formulierungen zusätzliche Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

Es ist bereits vorgeschlagen worden, Vitamin E, eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück.

Aufgabe der Erfindung war es daher, kosmetische, dermatologische und pharmazeutische Wirkstoffe und Zubereitungen sowie Lichtschutzformulierungen zu schaffen, die zur Prophylaxe und Behandlung lichtempfindlicher Haut, insbesondere von Photodermatosen, bevorzugt der polymorphen Lichtdermatose dienen.

Weitere Bezeichnungen für die polymorphe Lichtdermatose sind PLD, PLE, Mallorca-Akne und eine Vielzahl von weiteren Bezeichnungen, wie sie in der Literatur (z. B. A. Voelckel et al, Zentralblatt Haut- und Geschlechtskrankheiten (1989), 156, S.2), angegeben sind.

Hauptsächlich werden Antioxidantien als Schutzsubstanzen gegen den Verderb der sie enthaltenden Zubereitungen verwendet. Dennoch ist bekannt, daß auch in der menschlichen und tierischen Haut unerwünschte Oxidationsprozesse auftreten können.

Im Aufsatz "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" in "Oxidative Stress in Dermatology", S. 323 ff. (Marcel Decker Inc., New York, Basel, Hong Kong, Herausgeber: Jürgen Fuchs, Frankfurt, und Lester Packer, Berkeley/Californien), werden oxidative Schäden der Haut und ihre näheren Ursachen aufgeführt.

Auch aus dem Grunde, solchen Reaktionen vorzubeugen, können kosmetischen oder dermatologischen Formulierungen zusätzlich Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

Zwar sind einige Antioxidantien und Radikalfänger bekannt. So ist bereits in den US-Patentschriften 4,144,325 und 4,248,861 sowie aus zahlreichen anderen Dokumenten vorgeschlagen worden, Vitamin E, eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung

weit hinter der erhofften zurück.

Weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden und insbesondere die durch Umwelttoxinen verursachten Schäden dauerhaft, nachhaltig und ohne das Risiko von Nebenwirkungen zu beheben bzw. ihnen vorzubeugen.

Es hat sich überraschenderweise herausgestellt, daß die

Verwendung von Derivaten des Isoflavons gewählt aus der Gruppe: Genistein (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon), Genistin (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon-7-Glucosid), Daidzein (7,4'-Dihydroxy-Isoflavon), Equol (4',7-Dihydroxyisoflavan), Daidzin (7,4'-Dihydroxy-Isoflavon-7-Glucosid), Biochanin A (5,7-Dihydroxy-4'-Methoxy-Isoflavon), Glycitein (7,4'-Dihydroxy-6-Methoxy-Isoflavon), Glycitin (7,4'-Dihydroxy-6-Methoxy-Isoflavon-7-Glucosid), Santal (5,3',4'-Trihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon), Orobol (5,7,3',4'-Tetrahydroxy-Isoflavon), Pratensein (5,7,3'-Trihydroxy-4'-Methoxy-Isoflavon) und/oder Prunetin (5,4'-Dihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon), in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome von entzündlichen und/oder juckenden Hautzuständen, bei sensibler Haut sowie bei Veränderungen der DNS-Synthese und/oder DNS-Reparatur in der Haut den Nachteilen des Standes der Technik abhilft.

Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,001 bis 20 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,01 bis 5 Gew.-%, an erfindungsgemäßen Isoflavonen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Bei Anwendung der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe bzw. kosmetischer oder topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeter Wirkstoffe ist in überraschender Weise eine wirksame Behandlung von, aber auch eine Prophylaxe bei

- einer verminderten Hauthydratation bzw. eines verminderten Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,
- Dysfunktion der Stoffwechselhomeostase der Haut,

- einer verminderten Zell-Zell-Kommunikation,
  - einer verminderten DNS-Synthese und/oder einer verminderten DNS-Reparatur,
  - einer Aktivierung von Metalloproteinasen und/oder Proteasen,
  - Veränderungen der normalen Hyaluronsäure- und Glucosaminoglycan-Homeostase,
  - Abweichungen von den normalen posttranslationalen Modifikationen von Bindegewebsproteinen, Glycosaminoglycanen und anderen Strukturbestandteilen,
  - Störungen des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der Haut,
  - defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Hautzuständen oder defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Zustände von Hautanhangsgebilden,
  - Veränderungen des transepidermalen Wasserverlustes,
  - Veränderungen des natural moisturizing factor Gehaltes,
  - Veränderungen der normalen Lipidperoxidation,
  - entzündlichen Erscheinungen und/oder Juckreiz,
  - Schuppenbildung im Haarbereich
- möglich.

Es ist erfindungsgemäß insbesondere äußerst vorteilhaft, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff zur kosmetischen oder dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe unerwünschter Hautzustände zu verwenden.

Erfindungsgemäß können Zubereitungen, welche die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen enthalten, übliche Antioxidantien eingesetzt werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl-

und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulf-oximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsul-  
5 fone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitin-säure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Ap-felsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA  
10 und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B.  $\gamma$ -Linolensäure, Li-nolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Alanindiessigsäure, Flavonoide, Po-lyphenole, Catechine, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascor-byolphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), sowie Koniferylbenzoat des Benzoëharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und  
deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nor-  
15 dihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen De-  
rivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stil-benoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nu-  
kleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

20

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

25

Ferner kann es von Vorteil sein, die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zu verkapseln, z. B. als sogenannte solid lipid nanoparticles mit Hilfe von aufgeschmolzenen Wachsen, die unter anderem, aber nicht ausschließlich, gewählt sein können aus der Gruppe der Ester-wachse, Triglyceridwachse oder Kohlenwasserstoffwachse. Weiterhin kann es von Vorteil sein, die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Polymere zu verkapseln, z. B. in Partikel auf  
30 Basis hochvernetzter Polymethacrylate und/oder Cellulosetriacetate und/oder als Co-re/Shell-Partikel mit einer Hülle aus Poly(oxymethylurea), Nylon, Polyamide, Polyurethan, Polyester, Gelatine und/oder Polyolefinen.



Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, daß der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

Vorteilhaft kann der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff eingearbeitet werden in übliche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, welche in verschiedenen Formen vorliegen können. So können sie z. B. eine Lösung, eine Emulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), oder eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W) oder Öl-in-Wasser-in-Öl (O/W/O), eine Hydrodispersion oder Lipodispersion, eine Pickering-Emulsion, ein Gel, einen festen Stift oder auch ein Aerosol darstellen.

Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z. B. in Form einer Crème, einer Lotion, einer kosmetischen Milch sind vorteilhaft und enthalten z. B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff in wäßrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

5 Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

10

Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten.

15

Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcrème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu

20

Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescrèmes oder Makeup-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

30

Dementsprechend enthalten die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorzugsweise neben einem oder mehreren erfindungsgemäßen Wirkstoffen zusätzlich mindestens eine weitere UV-A- und/oder UV-B-Filtersubstanz. Die Formulierungen können,

obgleich nicht notwendig, gegebenenfalls auch ein oder mehrere organische und/oder anorganische Pigmente als UV-Filtersubstanzen enthalten, welche in der Wasser- und/oder der Ölphase vorliegen können.

- 5 Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwerlösliche oder unlösliche Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans ( $\text{TiO}_2$ ), Zinks ( $\text{ZnO}$ ), Eisens (z. B.  $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ), Zirkoniums ( $\text{ZrO}_2$ ), Siliciums ( $\text{SiO}_2$ ), Mangans (z. B.  $\text{MnO}$ ), Aluminiums ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), Cers (z. B.  $\text{Ce}_2\text{O}_3$ ), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden.

10

Solche Pigmente können im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft oberflächlich behandelt („gecoatet“) sein, wobei beispielsweise ein amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen

15 hydrophoben Schicht versehen werden.

Erfindungsgemäß vorteilhaft sind z. B. Titandioxidpigmente, die mit Octylsilanol beschichtet sind. Geeignete Titandioxidpartikel sind unter der Handelsbezeichnung T805 bei der Firma Degussa erhältlich. Besonders vorteilhaft sind ferner mit Aluminiumstearat beschichtete  $\text{TiO}_2$ -Pigmente, z. B. die unter der Handelsbezeichnung MT 100 T bei der Firma TAYCA erhältlichen.

20

Eine weitere vorteilhafte Beschichtung der anorganischen Pigmente besteht aus Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicon), einem Gemisch vollmethylierter, linearer Siloxanpolymere, die endständig mit Trimethylsiloxy-Einheiten blockiert sind. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Zinkoxid-Pigmente, die auf diese Weise beschichtet werden.

25

Vorteilhaft ist ferner eine Beschichtung der anorganischen Pigmente mit einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan, insbesondere Dimethylpolysiloxan mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten, und Silicagel, welches auch als Simethicone bezeichnet wird. Es ist insbesondere von Vorteil, wenn die anorganischen Pigmente zusätzlich mit Aluminiumhydroxid bzw. Aluminiumoxidhydrat (auch: Alumina,

30

CAS-Nr.: 1333-84-2) beschichtet sind. Besonders vorteilhaft sind Titandioxide, die mit Simethicone und Alumina beschichtet sind, wobei die Beschichtung auch Wasser enthalten kann. Ein Beispiel hierfür ist das unter dem Handelsnamen Eusolex T2000 bei der Firma Merck erhältliche Titandioxid.

5

Vorteilhaftes organisches Pigment im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) [INCI: Bisoctyl-triazol], welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

10

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

15

Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

20

Weitere vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind die Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimidazylate, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliopan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist.

25

30

Ferner vorteilhaft sind das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (besonders die entsprechenden 10-Sulfato-verbindungen, insbesondere das ent-

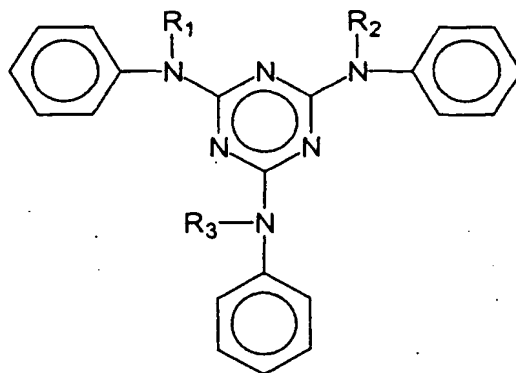
sprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird.

Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d.h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren.

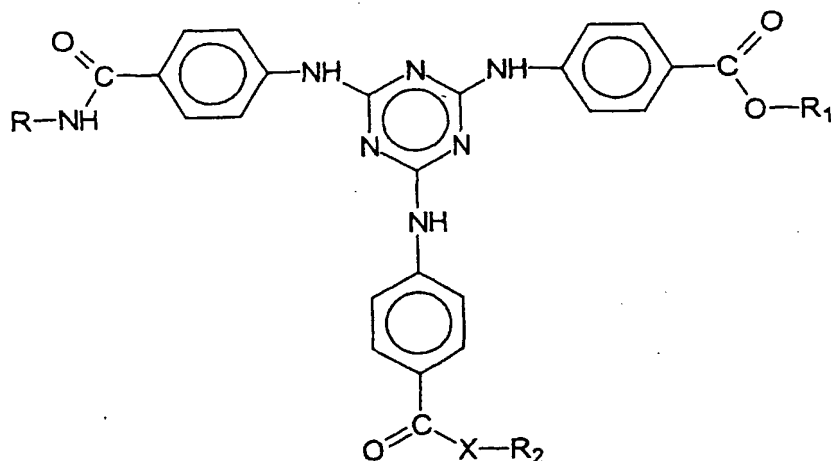
Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Bis-Resorcinyltriazinderivate. Insbesondere bevorzugt sind das 2,4-Bis-([4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Aniso Triazin), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten bevorzugt mehrere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Dibenzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan], Benzotriazolderivate [beispielsweise das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol)], Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und/oder ihre Salze, das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und/oder dessen Salze und/oder das 2,4-Bis-([4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander.

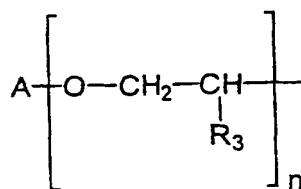
Auch andere UV-Filtersubstanzen, welche das Strukturmotiv



aufweisen, sind vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise die in der Europäischen Offenlegungsschrift EP 570 838 A1 beschriebenen s-Triazinderivate, deren chemische Struktur durch die generische Formel



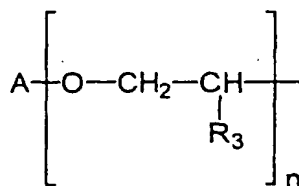
- 5 wiedergegeben wird, wobei
- R einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, darstellt,
- X ein Sauerstoffatom oder eine NH-Gruppe darstellt,
- R<sub>1</sub> einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, oder ein
- 10 Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel



- bedeutet, in welcher
- 15 A einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen,
- R<sub>3</sub> ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,
- n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

$R_2$  einen verzweigten oder unverzweigten  $C_1$ - $C_{18}$ -Alkylrest, einen  $C_5$ - $C_{12}$ -Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren  $C_1$ - $C_4$ - Alkylgruppen, darstellt, wenn X die NH-Gruppe darstellt, und

5 einen verzweigten oder unverzweigten  $C_1$ - $C_{18}$ -Alkylrest, einen  $C_5$ - $C_{12}$ -Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren  $C_1$ - $C_4$ - Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel



bedeutet, in welcher

10 A einen verzweigten oder unverzweigten  $C_1$ - $C_{18}$ -Alkylrest, einen  $C_5$ - $C_{12}$ -Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren  $C_1$ - $C_4$ - Alkylgruppen,

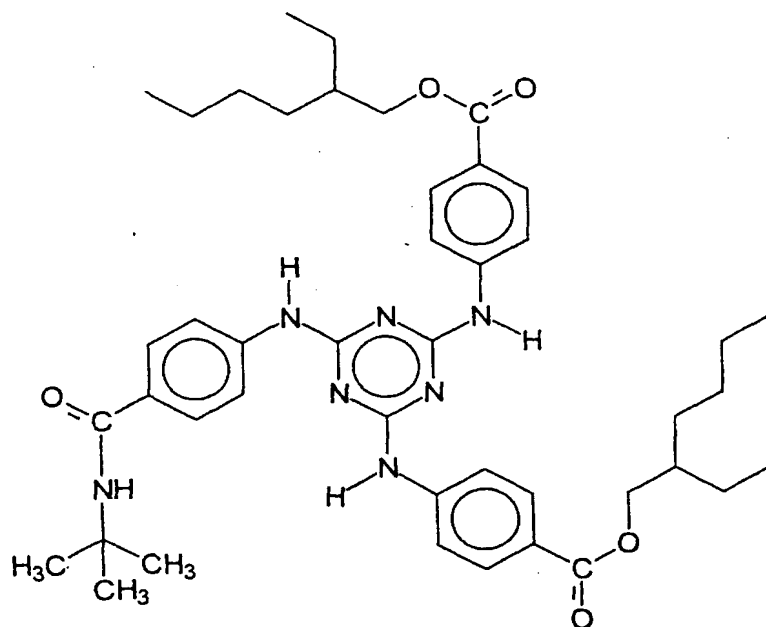
$R_3$  ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

15 wenn X ein Sauerstoffatom darstellt.

Besonders bevorzugte UV-Filtersubstanz im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner ein unsymmetrisch substituiertes s-Triazin, dessen chemische Struktur durch die Formel

15



wiedergegeben wird, welches im Folgenden auch als Dioctylbutamidotriazin (INCI: Dioctylbutamidotriazine) bezeichnet wird und unter der Handelsbezeichnung UVASORB HEB bei Sigma 3V erhältlich ist.

5

Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch ein symmetrisch substituiertes s-Triazin, das 4,4',4''-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoessäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazone), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung

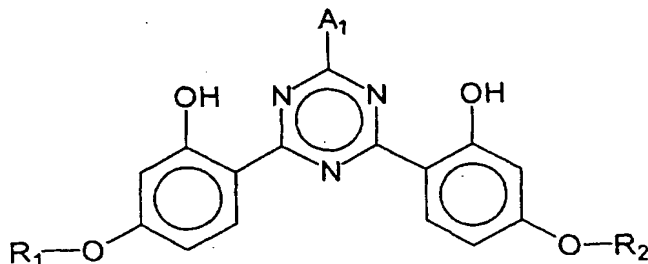
10

UVINUL® T 150 vertrieben wird.

Auch in der Europäischen Offenlegungsschrift 775 698 werden bevorzugt einzusetzende Bis-Resorcinyltriazinderivate beschrieben, deren chemische Struktur durch die generi-

15

sche Formel





wiedergegeben wird, wobei  $R_1$ ,  $R_2$  und  $A_1$  verschiedenste organische Reste repräsentieren.

Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner das 2,4-Bis-{{[4-(3-sulfonato)-  
 5 2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin Natriumsalz, das 2,4-Bis-{{[4-(3-(2-Propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{{[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-[4-(2-methoxyethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{{[4-(3-(2-propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-[4-(2-ethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{{[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(1-methyl-pyrrol-2-yl)-1,3,5-triazin, das  
 10 2,4-Bis-{{[4-tris(trimethylsiloxy-silylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{{[4-(2"-methylpropenyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-{{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin.

15

Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylenbis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

20 Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bezeichnung Drometrizole Trisiloxane.

25 Die UV-B- und/oder Breitband-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Vorteilhafte öllösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoessäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoessäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoessäureamylester;
- 30 ▪ 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;

- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon
- 5 ▪ sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

Vorteilhafte wasserlösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- 10 ▪ Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

Eine weitere erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist  
15 das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

Es kann auch von erheblichem Vorteil sein, polymergebundene oder polymere UV-Filter-  
substanzen in Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung zu verwenden, insbe-  
20 sondere solche, wie sie in der WO-A-92/20690 beschrieben werden.

Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, erfindungsgemäß weitere UV-A-  
und/oder UV-B-Filter in kosmetische oder dermatologische Zubereitungen einzuarbeiten,  
beispielsweise bestimmte Salicylsäurederivate wie 4-Isopropylbenzylsalicylat, 2-Ethyl-  
25 hexylsalicylat (= Octylsalicylat), Homomenthylsalicylat.

Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt  
werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

30 Vorteilhaft enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen die Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, in einer Gesamtmenge von z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmeti-

sche Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

- 5 Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen,
- 10 Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.
- 15 Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung im Sinne der vorliegenden Erfindung eine Lösung oder Emulsion oder Dispersion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:
- Wasser oder wäßrige Lösungen;
  - Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
  - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
  - 25 • Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

30

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

- Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisonanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylrucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.
- 15 Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.
- 25 Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.
- 30 Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Iseicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

- 5 Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird,  
10 außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne  
15 der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

20

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte,  
25 ferner insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der  
30 Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Feste Stifte enthalten z. B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fett-

säureester.

5 Übliche Grundstoffe, welche für die Verwendung als kosmetische Stifte im Sinne der vorliegenden Erfindung geeignet sind, sind flüssige Öle (z. B. Paraffinöle, Ricinusöl, Isopropylmyristat), halbfeste Bestandteile (z. B. Vaseline, Lanolin), feste Bestandteile (z. B. Bienenwachs, Ceresin und Mikrokristalline Wachse bzw. Ozokerit) sowie hochschmelzende Wachse (z. B. Carnaubawachs, Candelillawachs)

10 Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

15 Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

20

Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäßen Wirkstoff und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, 25 vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 30 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Erfindungsgemäß verwendete Gele enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend ge-

nanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

- 5 Es ist insbesondere vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenn die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen weitere Wirkstoffe enthalten, insbesondere natürliche Wirkstoffe und/oder deren Derivate, wie z. B. alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosylrutin, Carnitin, Carnosin, Kreatin, Klee-, Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt, Taurin und/oder  $\beta$ -Alanin.

10

Der Gehalt dieser Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) wird vorteilhaft aus dem Bereich von 0,0001 bis 30 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

- 15 Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, wobei unter der Bezeichnung „Isoflavonoide“ hier eine oder mehrere der folgenden Verbindungen zu verstehen sind: Genistein (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon), Genistin (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon-7-Glucosid), Daidzein (7,4'-Dihydroxy-Isoflavon), Equol (4',7-Dihydroxyisoflavan), Daidzin (7,4'-Dihydroxy-Isoflavon-7-Glucosid), Biochanin A (5,7-Dihydroxy-4'-Methoxy-Isoflavon), Glycitein (7,4'-Dihydroxy-6-Methoxy-Isoflavon), Glycitin (7,4'-Dihydroxy-6-Methoxy-Isoflavon-7-Glucosid), Santal (5,3',4'-Trihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon), Orobol (5,7,3',4'-Tetrahydroxy-Isoflavon), Pratensein (5,7,3'-Trihydroxy-4'-Methoxy-Isoflavon) und/oder Prunetin (5,4'-Dihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon).
- 20

Beispiele1. O/W Cremes

	1	2	3	4	5
Glycerylstearatcitrat	4,00		2,00		2,00
Glycerylsterat SE		3,00			
PEG-40-Stearat	1,00				
Polyglyceryl-3-Methylglucose Distearat				3,00	
Sorbitan Stearate					2,00
Stearic Acid		1,00			
Stearyl Alcohol			5,00		
Cetyl Alcohol	3,00	2,00		3,00	
Cetylstearylalcohol					2,00
Caprylic/Capric Triglyceride	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol			2,00		2,00
Dicaprylether		4,00		2,00	1,00
Mineral Oil	5,00	2,00		3,00	
TiO <sub>2</sub>			1,00		
4-Methylbenzylidene Camphor			1,00		
Butyl Methoxydibenzolymethane			0,50		
Isoflavonoide	0,20	0,50	0,10	1,00	0,30
Tococpherol	0,1				0,20
Biotin			0,05		
Trisodium EDTA	0,1		0,10	0,1	
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Carbomer	3,00	0,1		0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Butylene Glycol		3,00			
Parfuem	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Aqua	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100



	6	7	8	9	10
Glycerylstearatcitrat		2,00	2,00		
Glycerylsterat SE	5,00				
Stearic Acid				2,50	3,50
Stearyl Alcohol	2,00				
Cetyl Alcohol				3,00	4,50
Cetylstearylalcohol		3,00	1,00		0,50
C12-15 Alkyl Benzoate		2,00	3,00		
Caprylic/Capric Triglyceride	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Dicaprylether					
Mineral Oil		4,00	2,00		
Cyclomethicone				0,50	2,00
Dimethicone	2,00				
TiO <sub>2</sub>	2,00				
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00				1,00
Butyl Methoxydibenzolymethane	0,50				0,50
Isoflavonoide	0,20	0,70	0,25	2,00	0,40
Tococpherol					0,05
Trisodium EDTA			0,20		0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gum			0,20		
Carbomer	0,15	0,1		0,05	0,05
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	3,00		3,00	5,00	3,00
Butylene Glycol		3,00			
Alcohol Denat.		3,00		3,00	
Parfuem	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Aqua	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

**2. W/O Emulsionen**

	1	2	3	4	5
Cetyldimethicone Copolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
Ethylhexyl Methoxycinnamate		8,00		5,00	4,00
Aniso Triazine	2,00	2,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethane			2,00	1,00	
Diethyl Butamidotriazon	3,00	1,00			3,00
Ethylhexyl Triazone			3,00	4,00	
4-Methylbenzylidene Camphor		2,00		4,00	2,00
Octocrylene	7,00	2,50	4,00		2,50
Diethylbutamidotriazone	1,00			2,00	
Bisimidazylate	1,00	2,00	0,50		
Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid	0,50			3,00	2,00
Titandioxid		2,00	1,50		3,00
Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	0,50	
Mineralöl			10,0		8,00
C <sub>12-15</sub> Alkyl Benzoate				9,00	
Dicaprylyl Ether	10,00				7,00
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate			2,00	8,00	4,00
Dicaprylyl Carbonate	5,00		6,00		
Dimethicone		4,00	1,00	5,00	
Cyclomethicone	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin		0,30	1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja		1,00	1,50		
MgSO <sub>4</sub>	1,00	0,50		0,50	
MgCl <sub>2</sub>			1,00		0,70
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00

Isoflavonoide	0,10	0,60	1,50	1,00	0,80
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Methylparaben	0,50		0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	0,60
Ethanol	3,00		1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

	6	7
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00
Lanolin alcohol	0,50	1,50
Isohexadecane	1,00	2,00
Myristyl Myristate	0,50	1,50
Cera Microcristallina + Paraffinum Liquidum	1,00	2,00
Butyl Methoxydibenzoylmethane	0,50	1,50
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00	3,00
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate	4,00	5,00
Shea Butter		0,50
Butylene Glycol		6,00
Octoxyglycerin		3,00
Glycerin	5,00	
Vitamin E Acetat	0,50	1,00
Isoflavonoide	0,20	0,25
Trisodium EDTA	0,20	0,20
Methylparaben	q.s.	q.s.
Phenoxyethanol	q.s.	q.s.
Ethanol		3,00
Parfum	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100

**3. Hydrodispersionen**

	1	2	3	4	5
Ceteareth-20	1,00			0,5	
Cetyl Alkohol			1,00		
Sodium Carbomer		0,20		0,30	
Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylate Crosspolymer	0,50		0,40	0,10	0,10
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
Ethylhexyl Methoxycinnamate				5,00	8,00
Aniso Triazine		1,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethane	1,00		2,00		
Diethyl Butamidotriazon		2,00		2,00	1,00
Ethylhexyl Triazone	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzylidene Camphor	4,00	4,00			2,00
Octocrylene		4,00	4,00		2,50
Diethylbutamidotriazone	1,00			2,00	
Bisimidazylate	1,00		0,50		2,00
Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid	0,50			3,00	
Titandioxid	0,50		2,00	3,00	1,00
Zinkoxid	0,50	1,00	3,00		2,00
C <sub>12-15</sub> Alkyl Benzoate	2,00	2,50			
Dicaprylyl Ether		4,00			
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylyl Carbonate		2,00	6,00		
Dimethicone		0,50	1,00		
Phenyltrimethicone	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin			1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja			1,50		
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00

Isoflavonoide	0,15	0,60	1,50	1,00	0,80
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Koncyl - L ®	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Methylparaben	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Phenoxyethanol	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

**4. Beispiel (Gelcreme):**

	Massengehalt (%)
Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylate	0,40
Crosspolymer	
5 Carbomer	0,20
Xanthan Gum	0,10
Cetearyl Alkohol	3,00
C <sub>12-15</sub> Alkyl Benzoate	4,00
Caprylic/Capric Triglyceride	3,00
10 Cyclometicone	5,00
Dimeticone	1,00
Isoflavonoide	0,20
Glycerin	3,00
Natriumhydroxid	q.s.
15 Konservierung	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demineralisiert	ad 100,0
pH-Wert eingestellt auf 6,0	

20

**Beispiel (W/O-Creme )**

Lameform TGI	3,50
Glycerin	3,00
Dehymuls PGPH	3,50
25 Isoflavonoide	0,50
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Magnesiumsulfat	0,6
Isopropyl Stearate	2,0
30 Caprylyl Ether	8,0
Cetearyl Isononanoate	6,0
Wasser, demineralisiert	ad 100,0

Beispiel (W/O/W-Creme):

	Massengehalt (%)
5	Glyceryl Stearate
	3,00
	PEG-100 Stearate
	0,75
	Behenylalkohol
	2,00
	Caprylic/Capric Triglyceride
	8,0
	Octyldodecanol
	5,00
10	C <sub>12-15</sub> Alkyl Benzoate
	3,00
	Isoflavonoide
	1,00
	Magnesium Sulfat (MgSO <sub>4</sub> )
	0,80
	EDTA
	0,10
	Konservierung
	q.s.
15	Parfum
	q.s.
	Wasser, demineralisiert
	ad 100,0
	pH-Wert eingestellt auf 6,0



**Patentansprüche:**

1. Verwendung von Derivaten des Isoflavons gewählt aus der Gruppe:  
Genistein (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon), Genistin (5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon-7-Glu-  
5 cosid), Daidzein (7,4'-Dihydroxy-Isoflavon), Equol (4',7-Dihydroxyisoflavan), Daidzin  
(7,4'-Dihydroxy-Isoflavon-7-Glucosid), Biochanin A (5,7-Dihydroxy-4'-Methoxy-  
Isoflavon), Glycitein (7,4'-Dihydroxy-6-Methoxy-Isoflavon), Glycitin (7,4'-Dihydroxy-6-  
Methoxy-Isoflavon-7-Glucosid), Santal (5,3',4'-Trihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon), O-  
robol (5,7,3',4'-Tetrahydroxy-Isoflavon), Pratensein (5,7,3'-Trihydroxy-4'-Methoxy-  
10 Isoflavon) und/oder Prunetin (5,4'-Dihydroxy-7-Methoxy-Isoflavon)  
in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Pro-  
phylaxe der Symptome von entzündlichen und/oder juckenden Hautzuständen, bei  
sensibler Haut sowie bei Veränderungen der DNS-Synthese und/oder DNS-Repa-  
ratur in der Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome einer ne-  
15 gativen Veränderung der physiologischen Homeostase der gesunden Haut.
2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die Hautschäden und/oder negativen Hautzu-  
stände ein oder mehrere Erscheinungsbilder aus der folgenden Gruppe darstellen:
  - defizitäre, sensitive oder hypoaktive Hautzustände oder defizitäre, sensitive oder  
20 hypoaktive Zustände von Hautanhangsgebilden,
  - entzündliche Hautzustände sowie atopisches Ekzem, polymorphe Lichtderma-  
tose, Psoriasis, Vitiligo,
  - empfindliche, juckende oder gereizte Haut,
  - Veränderungen der normalen Lipidperoxidation,
  - 25 • Veränderung des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der gesunden Haut,
  - Veränderung des physiologischen transepidermalen Wasserverlustes,
  - Verminderung der Hauthydratation und Abnahme des Feuchtigkeitsgehaltes der  
Haut,
  - Veränderung des Natural Moisturizing Factor Gehaltes,
  - 30 • Verminderung der Zell-Zell-Kommunikation,
  - Mangelerscheinungen der intrazellulären DNS-Synthese,
  - DNS-Schädigungen und Verminderung von endogenen DNS-Reparaturmecha-  
nismen,

- Aktivierung von Metalloproteinasen und/oder anderer Proteasen bzw. Inhibierung der entsprechenden endogenen Inhibitoren dieser Enzyme,
  - Abweichungen von den normalen post-translationalen Modifikationen von Bindegewebsbestandteilen,
  - 5 • Veränderungen des normalen Hyaluronsäure- und Glycosaminoglycangehaltes der gesunden Haut,
  - Schuppenbildung der Haare.
- 10 3. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Isoflavonen (eine oder mehrere Verbindungen) in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,0005 bis 50,0 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20,0 Gew.-%, gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.
- 15 4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Isoflavonen (eine oder mehrere Verbindungen) in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,02 bis 10,0 Gew.-%, insbesondere von 0,5 bis 3,0 Gew.-% gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.
- 20 5. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen sich durch einen zusätzlichen Gehalt an einem oder mehreren der folgenden natürlichen Wirkstoffe und/oder deren Derivaten auszeichnen: alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosylrutin, Carnitin, Carnosin,
- 25 Kreatin, Klee-, Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt, Taurin, und/oder  $\beta$ -Alanin.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/087517 A3**

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 7/48, 31/35 (74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04625 (81) Bestimmungsstaaten (national): JP, US.
- (22) Internationales Anmeldedatum: 26. April 2002 (26.04.2002) (84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität: 101 21 375.1 2. Mai 2001 (02.05.2001) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BEIERSDORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BIERGIESSER, Helga [DE/DE]; Sandweg 16, 21465 Reinbek (DE). DÖRING, Thomas [DE/DE]; Quadenweg 3, 22453 Hamburg (DE). GALLINAT, Stefan [DE/DE]; Martin-Niemöller-Strasse 13, 22880 Wedel (DE). KOLBE, Ludger [DE/DE]; Wiesenstrasse 16, 21255 Döhren (DE). VENZKE, Kirsten [DE/DE]; Novalisweg 27, 22303 Hamburg (DE). STÄB, Franz [DE/DE]; Bäckerstrasse 3, 21279 Echem (DE).
- Erklärungen gemäß Regel 4.17:  
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten JP, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR)  
— Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Veröffentlicht:  
— mit internationalem Recherchenbericht
- (88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 27. Februar 2003
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: USE OF ISOFLAVONOIDS IN COSMETIC OR DERMATOLOGICAL PREPARATIONS FOR THE PROPHYLAXIS OR TREATMENT OF SENSITIVE SKIN

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON ISOFLAVONOIDEN IN KOSMETISCHEN ODER DERMATOLOGISCHEN ZUBEREITUNGEN ZUR PROPHYLAXE VOR UND BEHANDLUNG VON SENSIBLER HAUT

(57) Abstract: The invention relates to the use of derivatives of the isoflavones selected from the group: genistein, genistin, daidzein, daidzin, biochanin A, glycitein, glycitin, santal, orobol, pratensein, prunetin and/or equol, in cosmetic or dermatological preparations for the treatment and prophylaxis of the symptoms of inflammatory and/or itching skin conditions in sensitive skin and in changes to the DNS synthesis and/or DNS repair in the skin.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von Derivaten des Isoflavons gewählt aus der Gruppe: Genistein, Genistin, Daidzein, Daidzin, Biochanin A, Glycitein, Glycitin, Santal, Orobol, Pratensein, Prunetin und/oder Equol, in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome von entzündlichen und/oder juckenden Hautzuständen, bei sensibler Haut sowie bei Veränderungen der DNS-Synthese und/oder DNS-Reparatur in der Haut.

WO 02/087517 A3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern: Application No  
PCT/EP 02/04625

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 7 A61K7/48 A61K31/35

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K A61Q

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 56373 A (GORBACH SHERWOOD L) 17 December 1998 (1998-12-17) page 2, line 1-25; claims 1-7	1-5
X	WO 99 47118 A (PROCTER & GAMBLE) 23 September 1999 (1999-09-23) page 2 -page 8; claim 1	1-5
X	DE 44 32 947 A (NEW STANDARD GMBH) 21 March 1996 (1996-03-21) the whole document	1-5
X	POLA CHEMICAL INDUSTRIES: "Skin stress-decreasing compositions containing isoflavone or flavone derivatives" CAPLUS, XP002212265 the whole document	1-5

-/--

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

\*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

\*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

\*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

\*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

7 November 2002

Date of mailing of the international search report

13/11/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Lindner, A

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern: Application No

PCT/EP 02/04625

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	MIYAZAKI KOUJI ET AL: "Dermatological researches of isoflavone and Bifidobacterium-fermented soy milk extract" CAPLUS, XP002183472 the whole document	1-5
X	WO 01 08651 A (UNILEVER PLC ;LEVER HINDUSTAN LTD (IN); UNILEVER NV (NL)) 8 February 2001 (2001-02-08) page 8, line 1 -page 9, line 17; claims 1-8; example 6	1-5
X	WO 01 08652 A (UNILEVER PLC ;LEVER HINDUSTAN LTD (IN); UNILEVER NV (NL)) 8 February 2001 (2001-02-08) page 8, line 13 -page 9, line 29; claims 1-10; example 8	1-5
P,X	EP 1 180 331 A (UNILEVER PLC ;UNILEVER NV (NL)) 20 February 2002 (2002-02-20) page 2, line 39-43; claims 1-713-15; example 8 page 3, line 5-24	1,2,5
P,X	EP 1 104 672 A (SEROBIOLOGIQUES LAB SA) 6 June 2001 (2001-06-06) page 2, line 30-37; claims 1-10 page 9, line 25-47	1-5
E	WO 02 066001 A (PHARMASCIENCE LAB ;PICCARDI NATHALIE (FR); BROUTIN NICOLE (FR); MS) 29 August 2002 (2002-08-29) page 1, line 5-11; claims 1-16; examples 1-4	1-5
E	WO 02 076409 A (BIERGIESSER HELGA ;BEIERSDORF AG (DE); STAEB FRANZ (DE); GALLINAT) 3 October 2002 (2002-10-03) claims 1-10	1-5

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

nation on patent family members

Interr	Application No
PCT/EP	02/04625

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9856373	A	17-12-1998	US 6060070 A AU 7694298 A EP 0998262 A1 JP 2002511860 T WO 9856373 A1	09-05-2000 30-12-1998 10-05-2000 16-04-2002 17-12-1998
WO 9947118	A	23-09-1999	AU 2904899 A AU 3002299 A BR 9908869 A BR 9908870 A CA 2323181 A1 CA 2323364 A1 CN 1293564 T CN 1293565 T EP 1063966 A1 JP 2002506806 T JP 2002506807 T WO 9947118 A1 WO 9947119 A1 US 6051602 A US 6093411 A US 6235773 B1 US 2001012853 A1	11-10-1999 11-10-1999 21-11-2000 21-11-2000 23-09-1999 23-09-1999 02-05-2001 02-05-2001 03-01-2001 05-03-2002 05-03-2002 23-09-1999 23-09-1999 18-04-2000 25-07-2000 22-05-2001 09-08-2001
DE 4432947	A	21-03-1996	DE 4432947 A1	21-03-1996
WO 0108651	A	08-02-2001	AU 6692200 A CN 1376053 T WO 0108651 A1 EP 1198221 A1 US 6455057 B1	19-02-2001 23-10-2002 08-02-2001 24-04-2002 24-09-2002
WO 0108652	A	08-02-2001	AU 6985500 A CN 1376050 T WO 0108652 A1 EP 1198222 A1	19-02-2001 23-10-2002 08-02-2001 24-04-2002
EP 1180331	A	20-02-2002	EP 1180331 A1 AU 5780901 A US 2002068121 A1	20-02-2002 21-02-2002 06-06-2002
EP 1104672	A	06-06-2001	EP 1104672 A1 AU 1704601 A WO 0139738 A2 EP 1233747 A2	06-06-2001 12-06-2001 07-06-2001 28-08-2002
WO 02066001	A	29-08-2002	FR 2820974 A1 WO 02066001 A1	23-08-2002 29-08-2002
WO 02076409	A	03-10-2002	DE 10114305 A1 WO 02076409 A2	26-09-2002 03-10-2002

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern: Aktenzeichen  
PCT/EP 02/04625

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 A61K7/48 A61K31/35

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 A61K A61Q

Recherche aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 56373 A (GORBACH SHERWOOD L) 17. Dezember 1998 (1998-12-17) Seite 2, Zeile 1-25; Ansprüche 1-7	1-5
X	WO 99 47118 A (PROCTER & GAMBLE) 23. September 1999 (1999-09-23) Seite 2 -Seite 8; Anspruch 1	1-5
X	DE 44 32 947 A (NEW STANDARD GMBH) 21. März 1996 (1996-03-21) das ganze Dokument	1-5
X	POLA CHEMICAL INDUSTRIES: "Skin stress-decreasing compositions containing isoflavone or flavone derivatives" CAPLUS, XP002212265 das ganze Dokument	1-5
	-/-	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

7. November 2002

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

13/11/2002

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Lindner, A

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern: Aktenzeichen

PCT/EP 02/04625

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	MIYAZAKI KOUJI ET AL: "Dermatological researches of isoflavone and Bifidobacterium-fermented soy milk extract" CAPLUS, XP002183472 das ganze Dokument	1-5
X	WO 01 08651 A (UNILEVER PLC ;LEVER HINDUSTAN LTD (IN); UNILEVER NV (NL)) 8. Februar 2001 (2001-02-08) Seite 8, Zeile 1 -Seite 9, Zeile 17; Ansprüche 1-8; Beispiel 6	1-5
X	WO 01 08652 A (UNILEVER PLC ;LEVER HINDUSTAN LTD (IN); UNILEVER NV (NL)) 8. Februar 2001 (2001-02-08) Seite 8, Zeile 13 -Seite 9, Zeile 29; Ansprüche 1-10; Beispiel 8	1-5
P,X	EP 1 180 331 A (UNILEVER PLC ;UNILEVER NV (NL)) 20. Februar 2002 (2002-02-20) Seite 2, Zeile 39-43; Ansprüche 1-713-15; Beispiel 8 Seite 3, Zeile 5-24	1,2,5
P,X	EP 1 104 672 A (SEROBIOLOGIQUES LAB SA) 6. Juni 2001 (2001-06-06) Seite 2, Zeile 30-37; Ansprüche 1-10 Seite 9, Zeile 25-47	1-5
E	WO 02 066001 A (PHARMASCIENCE LAB ;PICCARDI NATHALIE (FR); BROUTIN NICOLE (FR); MS) 29. August 2002 (2002-08-29) Seite 1, Zeile 5-11; Ansprüche 1-16; Beispiele 1-4	1-5
E	WO 02 076409 A (BIERGIESSER HELGA ;BEIERSDORF AG (DE); STAEB FRANZ (DE); GALLINAT) 3. Oktober 2002 (2002-10-03) Ansprüche 1-10	1-5



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationale  
Kurzzeichen  
PCT/EP 02/04625

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9856373 A	17-12-1998	US 6060070 A AU 7694298 A EP 0998262 A1 JP 2002511860 T WO 9856373 A1	09-05-2000 30-12-1998 10-05-2000 16-04-2002 17-12-1998
WO 9947118 A	23-09-1999	AU 2904899 A AU 3002299 A BR 9908869 A BR 9908870 A CA 2323181 A1 CA 2323364 A1 CN 1293564 T CN 1293565 T EP 1063966 A1 JP 2002506806 T JP 2002506807 T WO 9947118 A1 WO 9947119 A1 US 6051602 A US 6093411 A US 6235773 B1 US 2001012853 A1	11-10-1999 11-10-1999 21-11-2000 21-11-2000 23-09-1999 23-09-1999 02-05-2001 02-05-2001 03-01-2001 05-03-2002 05-03-2002 23-09-1999 23-09-1999 18-04-2000 25-07-2000 22-05-2001 09-08-2001
DE 4432947 A	21-03-1996	DE 4432947 A1	21-03-1996
WO 0108651 A	08-02-2001	AU 6692200 A CN 1376053 T WO 0108651 A1 EP 1198221 A1 US 6455057 B1	19-02-2001 23-10-2002 08-02-2001 24-04-2002 24-09-2002
WO 0108652 A	08-02-2001	AU 6985500 A CN 1376050 T WO 0108652 A1 EP 1198222 A1	19-02-2001 23-10-2002 08-02-2001 24-04-2002
EP 1180331 A	20-02-2002	EP 1180331 A1 AU 5780901 A US 2002068121 A1	20-02-2002 21-02-2002 06-06-2002
EP 1104672 A	06-06-2001	EP 1104672 A1 AU 1704601 A WO 0139738 A2 EP 1233747 A2	06-06-2001 12-06-2001 07-06-2001 28-08-2002
WO 02066001 A	29-08-2002	FR 2820974 A1 WO 02066001 A1	23-08-2002 29-08-2002
WO 02076409 A	03-10-2002	DE 10114305 A1 WO 02076409 A2	26-09-2002 03-10-2002

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**